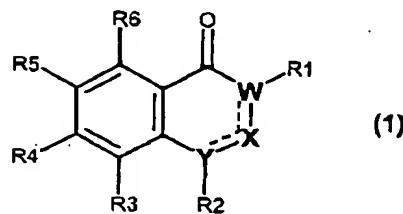


- 35 -

**Ansprüche****1. Verbindungen der allgemeinen Formel (1):**

5



10

worin

R<sup>1</sup> (a) eine Acylgruppe -CO-R11 oder CN ist, wobei R11 ein gesättigter, ungesättigter, cyclischer oder/und (hetero)aromatischer organischer Rest, insbesondere eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1 - 10 C-Atomen, oder eine ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierte Phenyl-, Furan- oder Thiophengruppe ist,  
 (b) eine Carbonsäureestergruppe -CO-OR12 oder Carbonsäuramid-gruppe -CO-NR12R13 oder eine Gruppe -SO<sub>x</sub>-R12 mit X = 0, 1 oder 2 oder -SO<sub>2</sub>-NR12R13 ist, wobei R12 ein gesättigter, ungesättigter, cyclischer oder/und (hetero)aromatischer organischer Rest, insbesondere eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen, eine Aralkylgruppe mit 7-20 C-Atomen, wobei der Arylrest ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituiert sein kann, oder ein ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierter Phenylrest ist und R13 ein Wasserstoffatom

20

25

- 36 -

oder eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen sein kann,

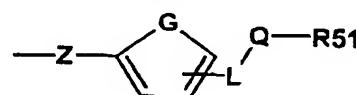
oder

(c) die Gruppe -A-NR14-CO-NR15R16 ist, worin A eine ggf. durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylgruppe substituierte Alkylengruppe mit 1-4 C-Atomen, insbesondere mit 1 C-Atom, eine Carbonylgruppe, ein Sauerstoffatom oder die Gruppe -SO<sub>X</sub> mit X = 0, 1 oder 2 ist, R14 und R15 jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom oder eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen sind und R16 eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen, eine Cycloalkylgruppe mit 3-10 C-Atomen, eine Cycloalkylalkylgruppe mit 7-20 C-Atomen, eine Aralkylgruppe mit 7-20 C-Atomen, wobei der Arylrest ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituiert sein kann, eine ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierte Phenylgruppe oder ein ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierter heterocyclischer Ring ist,

R2 eine Gruppe -CH(R21)R22, wobei R21 ein Wasserstoffatom, eine C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkylgruppe oder ein ggf. substituierter Phenylring und R22 ein ggf. substituierter Phenylring oder Naphthylring sind oder eine Gruppe -CH<sub>2</sub>CH(R23)R24, mit R23 und R24 in der Bedeutung eines ggf. substituierten Phenylringes ist,

R3 und R4 jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe mit 1-10 C-Atomen sind und R3 auch ein Halogenatomen sein kann,

R5 eine über den Rest Z verknüpfte Gruppe ist,

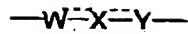


worin G -C=C-, -C=N-, -N=C-, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom ist, Z eine Direktbindung, ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom, die Gruppe CH-R52 oder -CHR52-CH-R53-

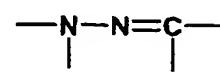
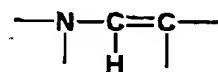
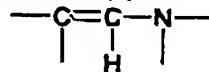
- 37 -

, wobei R52 und R53 unabhängig von einander die Bedeutung eines Wasserstoffatoms oder einer Alkylgruppe und n der Zahlen 1 und 2 haben, eine  $-C\equiv C-$ -Dreifachbindung oder eine E- oder Z-konfigurierte Gruppe  $-CR52=CR53-$  oder  $C=CR52R53$  ist, wobei R52 und R53 unabhängig von einander die Bedeutung eines Wasserstoffatoms oder einer Alkylgruppe haben, L eine  $CH_2$ - oder eine NH-Gruppe ist, Q eine Carbonyl- oder  $-SO_x$ -Gruppe mit  $X = 0, 1$  oder 2 ist und R51 eine ggf. durch eine Alkylgruppe substituierte Amino- oder eine gerade oder verzweigte, ggf. durch Halogenatome, Hydroxyl- oder Alkoxygruppen substituierte Alkyigruppe oder eine ggf. durch Halogenatome, Hydroxyl- oder Alkoxygruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3-7 Ringgliedern ist,

R6 die Gruppe  $CH_2-N(R61)R62$  ist, wobei R61 jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R62 eine Alkylgruppe oder eine ggf. substituierte Aralkylgruppe oder Heteroarylalkylgruppe mit 7-20 C-Atomen sind und



die Gruppen



20

in jeder Orientierung bedeuten kann, ferner alle Stereoisomeren der genannten Strukturen sowie Salze derselben mit physiologisch verträglichen Säuren oder Basen.

25

2. Verbindungen nach Anspruch 1,  
dadurch gekennzeichnet,

dass  $W-X-Y$  die Gruppe  $\begin{array}{c} N-C-C \\ | \quad | \end{array}$  oder  $\begin{array}{c} C-N-N \\ | \quad | \end{array}$  ist.

- 38 -

3. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass R1 die Gruppe -CO-R11 ist.

5 4. Verbindungen nach Anspruch 3,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass R11 aus Methyl, Ethyl, i-Propyl, Phenyl, 2-Thienyl und 2-Furyl  
ausgewählt ist.

10 5. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass R1 die Gruppe -CO-OR12 ist.

15 6. Verbindungen nach Anspruch 5,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass R12 aus Methyl, Ethyl oder i-Propyl ausgewählt ist.

20 7. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 6,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass R2 eine 2',5'-Difluorbenzylgruppe ist.

25 8. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 7,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass R3 und R4 Wasserstoffatome sind.

9. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 8,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass Z eine direkte Bindung oder ein Sauerstoffatom ist.

30 10. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 9,  
dadurch gekennzeichnet,  
dass G - C = C - bedeutet.

- 39 -

11. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 10,  
 dadurch gekennzeichnet,  
 dass L eine NH-Gruppe ist.

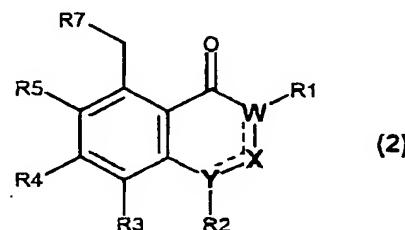
5 12. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 11,  
 dadurch gekennzeichnet,  
 dass Q eine Carbonylgruppe ist und R51 eine C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylgruppe ist.

10 13. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 12,  
 dadurch gekennzeichnet,  
 dass R61 ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe ist oder/und  
 R62 eine Benzylgruppe ist.

15 14. Verwendung von Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 13  
 als Antagonisten des Gonadotropin-freisetzen den Hormons (GnRH).

20 15. Verwendung nach Anspruch 14 zur männlichen Fertilitätskontrolle,  
 zur Hormontherapie, zur Behandlung weiblicher Sub- und Infertilität,  
 zur weiblichen Empfängnisverhütung und zur Tumorbekämpfung.

25 16. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel  
 (1) durch  
 (a) Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (2)



- 40 -

wobei R7 eine Abgangsgruppe bedeutet und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (3)

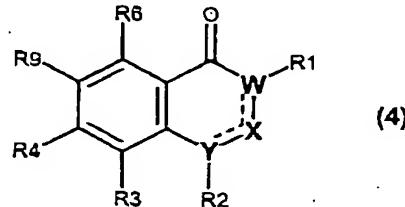
5

R8-N(R61)R62 (3)

wobei R8 ein Wasserstoffatom oder ein Metallatom bedeutet und R61 und R62 die bei Verbindung (1) angegebenen Bedeutungen haben,

10

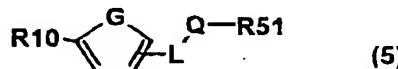
(b) Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (4)



15

worin R9 die Gruppe  $-\text{OSO}_2\text{C}_n\text{F}_{2n+1}$ , ein Halogenatom, besonders ein Brom- oder Jodatom oder eine andere Abgangsgruppe ist und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (5)

20



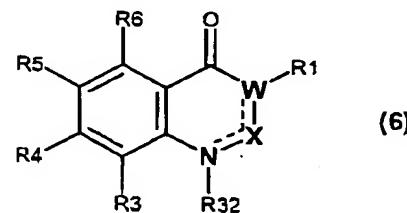
25

wobei R10 eine ein Metall oder ein Nichtmetall enthaltende Gruppe, eine ggf. in ein Metallsalz überführte Hydroxy- oder Mercapto-Gruppe, die Gruppe  $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{R31}$  oder eine E- oder Z-konfigurierte Gruppe  $-\text{CR52}=\text{CR53R31}$  oder  $-\text{CR31}=\text{CR52R53}$  ist, worin R31 eine ein Metall oder ein

- 41 -

Nichtmetall enthaltende Grupp ist und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit oder ohne Mitwirkung eines Katalysators;

5 (c) wenn Y in Verbindung (1) ein Stickstoffatom ist, durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (6)

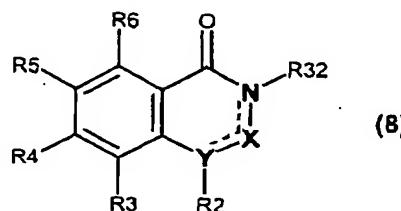


wobei R32 ein Wasserstoffatom oder ein Metallatom bedeutet und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (7).

10 R33-R2 (7)

15 wobei R33 eine Abgangsgruppe bedeutet und R2 die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung hat, oder

20 (d) wenn W in Verbindung (1) ein Stickstoffatom ist, durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (8)



- 42 -

wobei R32 ein Wasserstoffatom oder ein Metallatom bedeutet und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (9)

5

**R33-R1 (9)**

wobei R33 eine Abgangsgruppe bedeutet und R1 die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung hat.